

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

| | | |
|---|--|--|
| Applicant's or agent's file reference DS0070 | FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416) | |
| International application No. PCT/JP2003/012408 | International filing date (day/month/year) 29 September 2003 (29.09.2003) | Priority date (day/month/year) 30 September 2002 (30.09.2002) |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 31/145, 9/14, 9/16, 9/20, 9/48, 47/04, 47/38, A61P 3/00, 43/00 | | |
| Applicant DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD. | | |

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 4 sheets, including this cover sheet.
- ☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
- These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

| | |
|---|---|
| Date of submission of the demand 05 December 2003 (05.12.2003) | Date of completion of this report 07 April 2004 (07.04.2004) |
| Name and mailing address of the IPEA/JP | Authorized officer |
| Facsimile No. | Telephone No. |

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/012408

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
pages _____, as originally filed
pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP03/12408

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

| | | | |
|-------------------------------|--------|--------------|-----|
| Novelty (N) | Claims | 2, 3, 5-10 | YES |
| | Claims | 1, 4, 11, 12 | NO |
| Inventive step (IS) | Claims | | YES |
| | Claims | 1-12 | NO |
| Industrial applicability (IA) | Claims | 1-12 | YES |
| | Claims | | NO |

2. Citations and explanations

Document 1: JP 2001-187734 A (Taisho Pharmaceutical Co., Ltd.) July 10, 2001

Document 2: JP 9-143088 A (Taisho Pharmaceutical Co., Ltd.) June 3, 1997

Document 3: JP 54-122737 A (Daiichi Pharmaceutical Co., Ltd.) September 22, 1979

Document 4: JP 54-126737 A (Daiichi Pharmaceutical Co., Ltd.) October 2, 1979

<Claims 1, 11 and 12>

Based on the description in documents 1-4 cited in the international search report, the inventions of claims 1, 11 and 12 lack novelty and an inventive step.

Document 1 describes a tablet preparation in which granules and tablets are formed that contain pantethine, crystalline cellulose and light silicic anhydride (especially, Example 3).

Document 2 describes a tablet preparation in which a granulated product and tablets are formed that contain crystalline cellulose and silicic anhydride (Par. No. 0010), and it states that pantethine may also be included (Par. No. 0006).

Document 3 describes a powdered product to treat parodontosis that contains pantethine, crystalline cellulose, and light silicic anhydride, and it states that this powdered product may be produced as a tablet or other dosage form (claims, page 2, line 1 from the bottom of the upper left column to line 1 of the upper right column).

Document 4 describes a powdered product for prevention of thrombi that contains pantethine, crystalline cellulose, and light silicic anhydride, and it states that this powdered product may be produced as a tablet or other dosage form as desired (claims, page 2, lower left column, lines 4 to 7).

Because the expression "substantially" is used in claim 1, the preparations described in documents 1-4 cannot be clearly distinguished from the preparations of claims 1, 11 and 12.

Moreover, persons skilled in the art can easily change the dosage forms of the inventions described in documents 1-4 to another conventional solid dosage form other than tablets.

<Claim 4>

Based on the description in document 1 cited in the international search report, the invention of claim 4 lacks novelty and an inventive step.

Document 1 describes granules that contain 50 g of pantethine, 40 g of crystalline cellulose, and 5 g of light silicic anhydride (Example 3). Thus, the combined weight of the light silicic anhydride and the crystalline cellulose is 0.9 parts by weight with respect to 1.0 part by weight of pantethine.

Persons skilled in the art can easily establish an optimal range empirically for the weight ratio of the various constituents.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP03/12408

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of Box V.2 :

<Claims 2, 3, and 5-10>

Based on the descriptions in documents 1-4 cited in the international search report, the inventions of claims 2, 3, and 5-10 lack an inventive step.

Persons skilled in the art can easily establish optimal ranges empirically as needed for the content ratio of the various constituents, the mean particle size, etc., in the inventions described in documents 1-4. In addition, persons skilled in the art can easily conceive of selecting/using conventional items as the light silicic anhydrate and crystalline cellulose as desired.

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

REC'D 22 APR 2004

WIPO

PCT

| | | |
|---|---|---------------------------|
| 出願人又は代理人 の書類記号 DS0070 | 今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。 | |
| 国際出願番号 PCT/JPO3/12408 | 国際出願日 (日.月.年) 29.09.2003 | 優先日 (日.月.年) 30.09.2002 |
| 国際特許分類(IPC) Int. Cl ⁷ A61K31/145, 9/14, 9/16, 9/20, 9/48, 47/04, 47/38, A61P3/00, 43/00 | | |
| 出願人(氏名又は名称) 第一製薬株式会社 | | |

| |
|--|
| 1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条(PCT36条)の規定に従い送付する。 |
| 2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>4</u> ページからなる。 <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で _____ ページである。 |
| 3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 I <input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎 II <input type="checkbox"/> 優先権 III <input type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 IV <input type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如 V <input checked="" type="checkbox"/> PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI <input type="checkbox"/> ある種の引用文献 VII <input type="checkbox"/> 国際出願の不備 VIII <input type="checkbox"/> 国際出願に対する意見 |

| | | |
|---|------------------------------|---------|
| 国際予備審査の請求書を受理した日 05.12.2003 | 国際予備審査報告を作成した日 07.04.2004 | |
| 名称及びあて先 日本国特許庁(IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | 特許庁審査官(権限のある職員) 伊藤 幸司 | 4C 9450 |
| 電話番号 03-3581-1101 内線 3452 | | |

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書 第 _____ ページ、 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
図面 第 _____ ページ/図、 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)

| | | |
|-------|--------------|---|
| 請求の範囲 | 2, 3, 5-10 | 有 |
| 請求の範囲 | 1, 4, 11, 12 | 無 |

進歩性(IS)

| | | |
|-------|------|---|
| 請求の範囲 | | 有 |
| 請求の範囲 | 1-12 | 無 |

産業上の利用可能性(IA)

| | | |
|-------|------|---|
| 請求の範囲 | 1-12 | 有 |
| 請求の範囲 | | 無 |

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: JP 2001-187734 A (大正製薬株式会社) 2001.07.10
 文献2: JP 9-143088 A (大正製薬株式会社) 1997.06.03
 文献3: JP 54-122737 A (第一製薬株式会社) 1979.09.22
 文献4: JP 54-126737 A (第一製薬株式会社) 1979.10.02

<請求の範囲1、11及び12>

請求の範囲1、11及び12に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1～4より新規性及び進歩性を有しない。

文献1には、パンテチン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸を含む顆粒及び打錠した錠剤が記載されている(特に、[実施例3])。

文献2には、結晶セルロース、無水ケイ酸を含む造粒物及び打錠した錠剤が記載されており(第[0010]段落)、パンテチンを含有し得ることも記載されている(第[0006]段落)。

文献3には、パンテチン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸を含む菌周症用剤である散剤及び該散剤は錠剤その他の剤型によっても良いことが記載されている(特許請求の範囲、第2頁左上欄下から第2行～同頁右上欄第1行)。

文献4には、パンテチン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸を含む血栓予防剤である散剤及び該散剤は錠剤その他の剤型を適宜用いても良いことが記載されている(特許請求の範囲、第2頁左下欄第4～7行)。

そして、請求の範囲1の「実質的に」なる表現では、文献1～4に記載された製剤と請求の範囲1、11及び12に係る製剤とを明確に区別することはできない。

また、文献1～4に記載された発明において、錠剤以外の汎用の固形剤型に変えてみることは当業者が容易になし得ることである。

<請求の範囲4>

請求の範囲4に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1より新規性及び進歩性を有しない。

文献1には、パンテチン50g、結晶セルロース40g、軽質無水ケイ酸5gを含有する顆粒が記載されており([実施例3])、パンテチン1重量部に対する軟質無水ケイ酸及び結晶セルロースの合計量を計算すると0.9重量部である。

そして、各成分の重量比を最適な範囲に実験的に設定してみることは当業者が容易になし得ることである。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V.2 欄の続き

<請求の範囲 2、3 及び 5～10>

請求の範囲 2、3 及び 5～10 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 1～4 より進歩性を有しない。

文献 1～4 に記載された発明において、各成分の配合割合、平均粒径等を実験的に最適な範囲に適宜設定してみることは当業者が容易になし得ることである。また、軽質無水ケイ酸、結晶セルロースとして汎用のものを選択/適用してみることは当業者が適宜想到し得ることである。